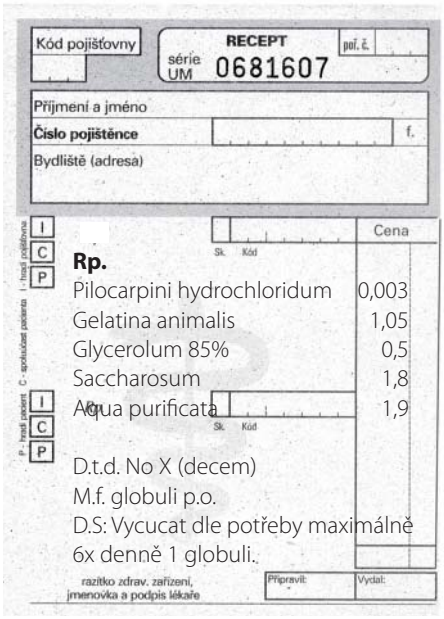
PILOKARPINOVÉ PERORÁLNÍ GLOBULE

PharmDr. Dobroslav Šrámek
Mgr. Petr Mlynář
Nemocniční lékárna,
FN Královské Vinohrady, Praha

Vzhledem k tomu, že v současné době není dostupná hmota na přípravu žvýkaček, v lékárnách je potřeba u pacientů s nedostatečnou funkcí slinných žláz podávat pilokarpin v alternativní formě, a to jako želatinové bonbony. Konzistence takto připravené lékové formy je podobná jako známí „želatinoví medvídci". Tato forma je mnohem vhodnější než například vodný perorální roztok pilokarpinu, protože má možnost dlouhodoběji působit lokálně na slinné žlázy v ústech.



Kód pojišťovny
RECEPT
série UM 0681607
poř. č.
Příjmení a jméno
Číslo pojištěnce
f.
Bydliště (adresa)
Cena
Rp.
Pilocarpini hydrochloridum 0,003
Gelatina animalis 1,05
Glycerolum 85% 0,5
Saccharosum 1,8
Aqua purificata 1,9
D.t.d. No X (decem)
M.f. globuli p.o.
D.S: Vycucat dle potřeby maximálně 6x denně 1 globuli.
razítko zdrav. zařízení, jmenovka a podpis lékaře
Připravil:
Vydal:

PILOKARPIN

Pilocarpini hydrochloridum

Pilokarpin je parasympatomimetikum. Je hlavním účinným alkaloidem mrštnoplodu léčivého (*Pilocarpus jaborandi*), z něhož byl izolován již v roce 1875. Struktura pilokarpinu byla objasněna již téměř před 100 lety. Imidazolové jádro a substituovaný tetrahydrofurananonový kruh jsou vzájemně spojeny methylenovým můstkem. Prostorové uspořádání ethylu na laktonovém kruhu (2*S* : 3*R*) je pro účinek rozhodující. Obměny této struktury měly za následek oslabení až vymizení cholinomimetických účinků, takže analogy pilokarpinu nenabyly praktického významu.

Pilokarpin je připravován izolací z přírodního materiálu, který obsahuje asi 0,5 % alkaloidů, z nichž 2/3 připadají na pilokarpin. Získává se extrakcí 1% roztokem chlorovodíku, odpařením a extrakcí chloroformem z amoniakálního prostředí.

Vlastnosti: Báze tvoří mazlavou hmotu s teplotou tání 34 °C, snadno rozpustnou ve vodě, 95% lihu i chloroformu. S kyselinami tvoří dobře krystalující soli, z nichž se používají hydrochlorid a dusičnan. Hydrochlorid tvoří velké bezbarvé, poněkud hygroskopické krystaly, tající při 198–202 °C. Jsou snadno rozpustné ve vodě a lihu, nepatrně rozpustné v organických rozpouštědlech. Vodné roztoky reagují kysele a jsou pravotočivé. V prostředí slaběji kyselém než pH = 5,0 jejich stabilita klesá. Při zvýšené teplotě a v alkalickém prostředí se štěpí laktonový kruh za vzniku neúčinné kyseliny pilokarpové. Pilokarpin nemá nikotinový účinek acetylcholinu.

Pilokarpin se používá v očním lékařství ke snížení nitroočního tlaku při glaukomu a jako miotikum ve formě 0,5–5% kapek. Pilokarpin rychle proniká rohovkou. Maximální miózy je dosaženo za 10–30 minut po aplikaci, maximálního snížení nitroočního tlaku za 1,5–3 hodiny, mióza přetrvává 4–10 hodin, snížení nitroočního tlaku 4–14 hodin (v závislosti na použitém množství přípravku).

Pilokarpinu se užívá ke zvýšení sekrece slinných a potních žláz a jako farmakologického standardu.

POMOCNÉ LÁTKY

Glycerol

Synonyma: Glycerina Oxydum, glycerylicum, Principium dullce oleorum, cukr tukový, sladotuk, tukosladina, Oelsüss, Lebensöl, Sacharum Melcannae, Sacharum canariense, Sacharum farinae, Casonade, Lumpenzucker, Puderbrod, Raffinade, Weisser Farin, Melis čistý.

Glycerol-1,2,3-propantriol je hustá sladká kapalina, převážně získávaná zmýdelňováním a hydrolýzou tuků. Ve farmacii se nejčastěji používá při výrobě topických přípravků, jako humektant v koncentraci do 5 %, dále se používá jako složka směsných rozpouštědel nebo jako rozpouštědlo. Slouží také při výrobě syntetických a semisyntetických tuků a povrchově aktivních látek. Kromě toho je využíván při výrobě výbušnin, plastických hmot jako plastifikátor, ve výtvarné praxi, při přípravě lepidel a tmelů a alkoholických nápojů.

Cukr

Sacharóza je disacharid vyráběný převážně z cukrové řepy, eventuálně z cukrové třtiny. Ve farmacii je používán převážně jako chuťové korigens, popřípadě jsou využívány pojivé vlastnosti jejího roztoku. Koncentrované roztoky sacharózy jsou hypertonické a mají konzervační účinky. Mimo farmacii je těžiště jejího využití především v potravinářství jako sladidlo a potravina s velkou nutriční hodnotou.

Želatina

Synonyma: Gelatina animalit, Gelatina gallica, Gelatina pellucida, Gelatinium, klihovina, rosolina

Želatina se vyrábí hydrolýzou tkání bohatých na kolagen z různých živočišných druhů (např. vepřové a hovězí kůže a kosti, rybí kůže, králičí kůže apod.). Ve farmacii se používá v nejrůznějších aplikacích. Jsou využívány její gelotvorné anebo pojivé vlastnosti, například při výrobě vaginálních a perorálních globulí nebo gelového krytí na rány. Další využití je jako pojivo při výrobě granulátu před tabletováním, při výrobě želatinových kapslí, při přípravě bakteriologických půd, při čeření zakalených roztoků. Velmi široké je spektrum využití želatiny v nefarmaceutických oborech (např. světlocitlivé emulze ve fotografii, sítotisk a ve výtvarné praxi). Velmi široké je využití želatiny v potravinářství.

ZÁVĚR

Pilocarpin se používá ve stomatologii a otorinolaryngologii při nedostatečné funkci slinných žláz a při kamenech ve slinných žlázách. Globule se cucají podle potřeby, při obsahu 3 mg pilocarpinu v 1 globuli maximálně 6x denně.

Stabilita: Globule mají použitelnost 1 měsíc při balení v celofánu v nádobách dobře uzavřených.

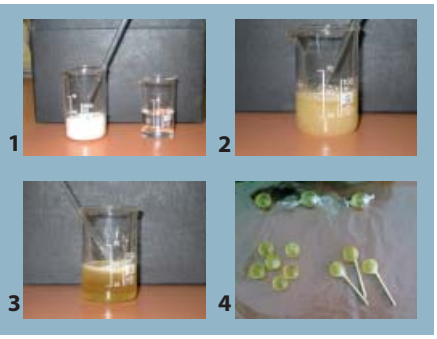
Uchovávání: 2–8°C

Poznámka: V případě diabetika může být sacharóza nahrazena umělým sladidlem, vzhledem k tomu že zatím nikdo nepožadoval tyto globule s umělým sladidlem, zatím jsme nezkoušeli připravovat, ale lze předpokládat, že by to neměl být technologický problém.

PŘÍPRAVA PERORÁLNÍCH GLOBULÍ

Práškové suroviny smísíme a zalijeme v kádince směsí tekutých surovin. Je-li to možné z časových důvodů, necháme směs asi půl hodiny bobtnat. Potom ji zahřejeme ve vodní lázni nebo v mikrovlnné troubě na asi 60–70 °C. Opatrně promícháváme a vyčkáme do úplného rozpuštění pevných částic. Podle potřeby přihříváme a doplňujeme odpařenou vodu. Snažíme se míchat opatrně, abychom do směsi nevháněli vzduch, a po úplném rozpuštění odléváme globule. Do dosud tekuté hmoty ve formě můžeme vkládat připravené kousky špejlí. Takto získáme lízátka.

Tato hmota je vhodná také pro přípravu anestetických lízátek. V tomto případě je účinná látka pilokarpin nahrazena například trimecaini hydrochloridem nebo jiným vhodným lokálním anestetikem. Také by šly vyrobit globule s přídavkem lokálního desinficiencia, například s chlorhexidinem samotným nebo v kombinaci právě s lokálním anestetikem.



1 2 3 4